

⑩ 日本国特許庁(JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A)

昭64-83022

⑬ Int. Cl.⁴

A 61 K 35/78
7/00
7/06
7/16
7/42

識別記号

ABE

庁内整理番号

8413-4C
7306-4C
7430-4C
7430-4C
6971-4C

⑭ 公開 昭和64年(1989)3月28日

審査請求 未請求 発明の数 1 (全4頁)

⑮ 発明の名称 皮膚外用剤

⑯ 特 願 昭62-238367

⑰ 出 願 昭62(1987)9月22日

⑱ 発 明 者 林 達 男 神奈川県小田原市扇町5丁目14-12-163

⑲ 出 願 人 ライオン株式会社 東京都墨田区本所1丁目3番7号

⑳ 代 理 人 弁理士 中 村 稔 外5名

明 細 書

1. 発明の名称 皮膚外用剤

2. 特許請求の範囲

- (1) セージまたはローズマリーの低級アルコール抽出物を含有することを特徴とする皮膚外用剤。
- (2) セージまたはローズマリーの低級アルコール抽出物が、セージまたはローズマリーを非極性溶剤で、または水蒸気蒸留で抽出した残液を、低級アルコールで抽出したものである特許請求の範囲第(1)項記載の皮膚外用剤。

3. 発明の詳細な説明

〔産業上の利用分野〕

本発明は、特定の植物から抽出された抽出物を配合した皮膚外用剤、例えば皮膚の日焼け後のほてり、肌荒れ、カミソリ負け等の皮膚の炎症を防止する皮膚外用剤に関するものである。

〔従来の技術〕

生薬の抽出物は、種々の用途に幅広く使用されている。例えば、特開昭60-178818号公報には、ローズマリー、セージ(サルビア)などを含有するアドリアマイシン製剤が開示され、特開昭61-238718号公報にはローズマリーを含有してなるフケ防止用頭髮化粧料が開示されている。又、特開昭1-24522号公報には、ローズマリー、セージ(サルビア)など多数の抗酸化能を有する生薬抽出物を含有する皮膚過酸化脂質生成抑制剤生成物が開示されているが、セージまたはローズマリーの低級アルコール抽出物を皮膚外用剤として用いることが具体的に記載されていない。

一方、抗炎症を目的とする皮膚外用剤の有効成分は、一般的にインドメタシン、グリチルリチン酸、アラントインなどが用いられているが、医薬部外品レベルで十分効果を発揮しえるものはほとんどないのが現状であり、医薬品に限らず医薬部外品として幅広く利用でき、かつ副作用のない皮膚外用剤の開発が望まれている。

〔発明が解決しようとする問題点〕

従って、本発明は優れた抗炎症作用を有し、かつ副作用のない皮膚外用剤を提供することを目的とする。

〔問題点を解決するための手段〕

本発明は、数ある生薬を種々の溶剤で抽出し、セルモットの背部皮膚にアラキドン酸を塗布して生じさせた紅斑に、該抽出物を塗布して抗炎症作用を検討した結果、セージまたはローズマリーの特定溶媒での抽出物が優れた抗炎症作用を示すとの知見に基づいてなされたのである。

すなわち、本発明はセージまたはローズマリーの低級アルコール抽出物を含有することを特徴と

する皮膚外用剤を提供する。

本発明で抽出に用いる低級アルコールとしては、炭素数1~4のアルコール、例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノールなどがあげられる。このうちエタノールが好ましく、含水エタノールでもよいが、エタノール100%が最も好ましい。又、抽出に際しては、セージまたはローズマリーの花、葉、茎等種々の部位、好ましくは全草の乾燥物を用い、該乾燥物に対して3~20倍量(重量)、より好ましくは5~10倍量の低級アルコールを用いて10~70℃で抽出を行うのがよい。尚、低級アルコールでの抽出に先だちセージまたはローズマリーを非極性溶剤で、または水蒸気蒸留で抽出して残渣を得、次いで該残渣を低級アルコールで抽出するほうがより好ましい。

ここで非極性溶剤としては、石油エーテル、n-ヘキサン、シクロヘキサン、四塩化炭素、クロロホルム、ジクロルメタン、エチレンクロライド(ジクロルエタン、モノクロルエタン等)、トル

3

エン、ベンゼン等の一種又二種以上の混合物を用いることができる。このうち、n-ヘキサンが好ましい。非極性溶剤を用いる場合、原料1重量部に対して3~10重量部添加して残渣を得るのが好ましい。抽出方法としては、パッチ法、還流法など通常の方法で行うことができ、室温でも加温下でも行うことができる。尚、抽出残渣は常法により、例えばデカンテーションなどにより採取することができる。

一方、水蒸気蒸留を行う場合には、初留から1~2時間行うのがよい。

このように、低級アルコール抽出に先だて非極性溶剤で又は水蒸気蒸留により、不用分を予め除去しておくと、目的とする有効成分の純度を高め、さらには非極性溶剤又は水蒸気蒸留により得られた成分は香料原料として別途用いることができる。

本発明では、上記の低級アルコール抽出物をそのまま又は抽出物溶剤を除去した後、単独で又は皮膚外用剤として用いられるグリチルリチン酸及

4

びその誘導体、ビタミンE、アラントイン、インドメタシン、γ-オリザノールなどと共に用いることができる。又、界面活性剤、香料、粘着剤などを添加できる。さらに、賦形剤や基剤などと混合して製剤化することができる。

上記低級アルコール抽出物は、皮膚外用剤に0.01~20%、好ましくは0.10~10%の量で含有される。尚、本発明の皮膚外用剤は、製剤化しても液状でも任意の形態で使用することができる。

〔発明の効果〕

皮膚に紫外線、化学薬品、冷熱などの刺激が加わると細胞膜からアラキドン酸が放出され、シクロオキシゲナーゼを介して様々なプロスタグランジン類に代謝されるが、なかでもプロスタグランジンE₂やトロンボキサンA₂は炎症における化学メディエーターと相乗的に作用し炎症反応を増強する。これに対して、上記抽出物を含む本発明の皮膚外用剤はアラキドン酸の代謝を抑え、肌荒れ、日焼けなどの症状を効果的に緩和することができる。

5

6

るのである。

従って、本発明の皮膚外用剤は、皮膚の炎症を治療あるいは予防することができ、しかも副作用がないので、肌荒れ防止、肌荒れ改善、皮膚の日焼け雪焼け防止、カミソリ負け、おむつかぶれ、皮膚の日焼け後のほてり防止等広範囲に使用することができる。

次に、本発明を実施例により説明する。

〔実施例〕

製造例

製造例 1

セージ粉末 1 kg を蒸留釜に入れ、2 時間水蒸気蒸留を行い、精油を取り除いた残渣にエタノール溶液 5 ℓ を加え、60℃ に加温しながら 3 時間抽出処理を行った。得られた抽出液を減圧下濃縮して溶媒を完全に除去した抽出物 140 g を得た（セージ抽出物 No. 1）。

製造例 2

ローズマリー粉末 1 kg を蒸留釜に入れ、1 時間水蒸気蒸留を行い、精油を取り除いた残渣にエタ

ノール溶液 5 ℓ を加え、60℃ に加温しながら 3 時間抽出処理を行った。得られた抽出液を減圧下濃縮して溶媒を完全に除去した抽出物 135 g を得た（ローズマリー抽出物 No. 1）。

製造例 3

セージ粉末 1 kg に 10 ℓ のヘキサンを加えて室温で攪拌しながら 8 時間抽出を行い、精油及び樹脂等を取り除いた残渣にエタノール溶液 5 ℓ を加え、60℃ に加温しながら 3 時間抽出処理を行った。得られた抽出液を減圧下濃縮して溶媒を完全に除去した抽出物 145 g を得た（セージ抽出物 No. 2）。

製造例 4

ローズマリー粉末 1 kg に 10 ℓ のヘキサンを加えて室温で攪拌しながら 8 時間抽出を行い、精油及び樹脂等を取り除いた残渣にエタノール溶液 5 ℓ を加え、60℃ に加温しながら 3 時間抽出処理を行った。得られた抽出液を減圧下濃縮して溶媒を完全に除去した抽出物 138 g を得た（ローズマリー抽出物 No. 2）。

7

製造例 5

セージ粉末 1 kg にエタノール 5 ℓ を加え、60℃ に加温しながら 3 時間抽出処理を行った。この処理を 3 回くり返し、得られた抽出液を減圧下濃縮して溶媒を完全に除去した抽出物 230 g を得た（セージ抽出物 No. 3）。

製造例 6

ローズマリー粉末 1 kg にエタノール 5 ℓ を加え、60℃ に加温しながら 3 時間抽出処理を行った。この処理を 3 回くり返し、得られた抽出液を減圧下濃縮して溶媒を完全に除去した抽出物 240 g を得た（ローズマリー抽出物 No. 3）。

実施例 1

ハートレー系モルモット（オス、4 週令）を 1 週間予備飼育した後、背部を除毛し、24 時間後にアラキドン酸の 0.5% アセトン溶液を 1 部位 1 cm × 1 cm 当たり 10 μℓ 塗布し炎症を起こさせた後、ここに、1 時間後、2 時間後及び 3 時間後に上記抽出物 No. 1～3 の 5% エタノール溶液（本発明の皮膚外用剤：抽出物を乾燥重量として 5% 含

8

有）を塗布し、炎症治療効果を調べた。

また、炎症予防効果については、炎症をおこさせる 3 時間前、2 時間前、1 時間前に上記抽出物 No. 1～3 の 5% エタノール溶液を塗布して、炎症の起こり方を調べた。尚、コントロールとして、エタノール溶液を用いた。

結果をまとめて表-1 に示すが、表中の値は試験数 3 の結果であり、各試験数の間に振れはなかった。

表-1

サ ン プ ル	予 防 効 果	治 療 効 果
セージ抽出物 No. 1 使用	—	±
セージ抽出物 No. 2 使用	—	±
セージ抽出物 No. 3 使用	±	+
ローズマリー抽出物 No. 1 使用	—	±
ローズマリー抽出物 No. 2 使用	—	±
ローズマリー抽出物 No. 3 使用	±	+
コントロール	++	++

9

10

表中、 - : 発赤は認められない。
 ± : わずかに発赤が認められる。
 + : 発赤が認められる。
 ++ : 激しい発赤が認められる。

実施例 2

製造例 1 ~ 3 で製造した抽出物を用い、下記の皮膚外用剤を調製した。

皮膚外用液

ソルビット	2.0 %
グリセリン	3.0
ポリオキシエチレン オレイルエーテル	1.0
エタノール	15
ローズマリー抽出物 No. 1	1.0
クエン酸	0.1
パラフェノールスルホン酸亜鉛	0.2
香料、防腐剤	適量
水	残部
合 計	100 %

ヒゲソリ用ローション

エタノール	40.0 %
メントール	0.05
ベンジルアルコール	0.25
グリチルリチン酸	0.1
ポリオキシエチレン硬化 ヒマシ油モノビロゲル タメートモノイソステアレート	0.7
セージ抽出物 No. 2	0.5
香料	適量
水	残部
合 計	100 %